

①日本国特許庁(JP)

①特許出願公開

⑫公開特許公報(A)

昭54—70420

⑤Int. Cl.<sup>2</sup>  
A 61 K 47/00

識別記号 ⑤日本分類  
30 C 5

庁内整理番号 ④公開 昭和54年(1979)6月6日  
7057—4C

発明の数 1  
審査請求 未請求

(全 3 頁)

⑤医薬品製剤用結合剤

⑦発明者 藤原和男

神戸市東灘区住吉台5番2—90  
4号

①特 願 昭52—135439

②出 願 昭52(1977)11月10日

⑦発明者 大橋司郎

堺市平岡町278の8

①出願人 三栄化学工業株式会社

豊中市三和町1丁目1番11号

明 細 書

1. 発明の名称 医薬品製剤用結合剤

2. 特許請求の範囲

キサンタンガムとローカストビーンガムとからなる水性ゲルを、又はカラギーナンの水性ゲルを結合剤とする医薬品製剤用結合剤。

3. 発明の詳細な説明

この発明は、医薬製剤用の結合剤に係るものであり、工業的製造に有利な、かつ結合効果の高い結合剤を取得することを目的とする。

医薬品製剤中であつてパップ剤、軟こう、坐剤、パスタ剤、丸剤、トローチ剤等は、主剤たる粉末状医薬品を、水性結合剤を用いて糊状、粘稠状、あるいは固状に集結合したものであり、その結合剤としては一般にゼラチンの水性ゲルが使用されている。しかし、ゼラチンの水性ゲルを使用した結合剤は欠点がある。例えば、これを使用するパップ剤についてみると、かかるパップ剤を人体に施用する場合、夏期高温時には、パップ剤自体が施用すべき個所以外に流出して被覆面積を不必要に拡大するから、着衣の汚染が起こり、かつ施

用すべき個所への薬効が薄くなる。その理由はゼラチンの流動開始点が約25°Cであつて気温、人体温に比較して低すぎるからである。

この発明は、かかる結合剤の欠点を除去した新しい結合剤に係るものであつて、以下にその詳細を説明する。

この発明に係る結合剤は、キサンタンガム、ローカストビーンガムの混合物からなる水性ゲル、又はカラギーナンの水性ゲルである。

キサンタンガムとローカストビーンガムとは、何れもこれを単種で使用するときは、含水状にしてもゲル化を起こさないから、これら両者は併用しなければならない。併用量はキサンタンガム1～10部(重量、以下同じ)にたいしローカストビーンガム1～10部でよい。カラギーナンは、単用することができる。

これらの水性ゲルをつくる。キサンタンガムとローカストビーンガムの混合物あるいはカラギーナン5～10部にたいし、水及び又はグリセリン100部でよい。

この混合系を加熱する。ゲル化温度について、キサンタンガムとローカストビーンガムの併用物のときは約40°Cであり、カラギーナンのときは50°C前後である。

これらガム質を相手の医薬品の結合のために使用すべき量は、医薬品にたいし1%（重量、以下同じ）前後量でよい。もちろん、製剤の態様、例えばパスタ剤、丸剤の違いを勘案してその使用量を加減すべきは明らかである。

この発明の結合剤の主剤ガムは何れもそのゲル化温度が人体温及び夏期の高温より相当に高いから、公知の結合剤ゼラチンに比べて遙かに熱安定性が良好であり、更に熱分解を起こし難く、つれてこの結合剤を用いた製剤の熱安定性が極めて高い。また、使用に当って簡便であり、更には、人体に無害である。このように、この結合剤は医薬剤の目的にとって極めて良質である。

次に、この発明の実施の態様を例示する。

#### 例 1. パップ剤

カオリン 550g

に溶解した溶液を加え、均等になる迄加熱攪拌し、よくねりませて圧さくして水分を除き成型して単鉛軟こうを製造した。

#### 例 3 坐剤

薬物 1g  
水 9g  
キサンタンガム 1.5g  
ローカストビーンガム 0.5g  
グリセリン 88g

水にローカストビーンガムを溶解し、これに薬物を加えて分散懸濁又は溶解せしめ、更にグリセリンを加えた後、キサンタンガムを加え、水浴上で加熱し、これを型に流し込んで冷却固化させて坐剤を製造した。

#### 例 4. パスタ剤

亜鉛華 25g  
デンプン 25g  
白色ワセリン 50g  
カラギーナン 1g

亜鉛華、デンプン、及びカラギーナンを少

特開昭54-70420(2)

ホウ酸 50g  
チモール 0.5g  
サリチル酸メチル 2ml  
ハツカ油 0.5ml  
キサンタンガム 1g  
ローカストビーンガム 1g

グリセリンにキサンタンガム、及びローカストビーンガムを加え、90~110°Cに加熱溶解し、更にホウ酸を加えて、これに乾燥したカオリンを混合し、50~60°Cでチモールをサリチル酸メチル及びハツカ油にとかしたものを加え混和してパップ剤を製造した。

#### 例 2. 単鉛軟こう

植物油 100g  
豚脂 100g  
一酸化鉛細末 100g  
水 130ml  
カラギーナン 2.0g

植物油、豚脂を溶解し、一酸化鉛を加えて混和した後、あらかじめ、カラギーナンを水

量ワセリンでねり、残りのワセリンとまぜて全質均等にしてパスタ剤を製造した。

#### 例 5. 丸剤

硫酸アトロピン 0.05g  
ブドウ糖 25g  
デンプン 1.5g  
キサンタンガム 0.1g  
ローカストビーンガム 0.1g  
グリセリン 2g  
水 1g

グリセリンと水の混液にキサンタンガム、ローカストビーンガムを加え、加熱溶解せしめ、ついでデンプン、ブドウ糖、硫酸アトロピンなどを加えよくねり合せて、成型し乾燥して丸剤を製造した。

#### 例 6. トローチ剤

スルファジアジン 10g  
炭酸水素ナトリウム 2g  
砂糖 4g  
デキストリン 1g

カラギーナン 3 g

水 適量

水以外の薬品を均等に混和したのち、水を加えペースト状とする。細長い円柱状にしたのち分割成形し乾燥してトローチ剤を製造した。

例 7. カプセル剤

ゼラチン 10 g

キサンタンガム 0.15 g

ローカストビーンガム 0.20 g

グリセリン 10.4 g

水 16.7 g

水とグリセリンの混液にゼラチン、キサンタンガム、ローカストビーンガム、を加えて加熱溶解した後、常法によりカプセル剤を製造した。

特許出願人 三栄化学工業(株)